

NOVEL FLUOROURACIL DERIVATIVE

Patent number: JP55059173
Publication date: 1980-05-02
Inventor: ITABASHI KUNIO
Applicant: KAKEN PHARMACEUT CO LTD
Classification:
- international: C07D239/54
- european:
Application number: JP19780131480 19781027
Priority number(s):

BEST AVAILABLE COPY

Abstract of JP55059173

NEW MATERIAL: A 5-fluorouracil derivative of the formula (Y is SO₃, CO₂, or SO₂).

EXAMPLE: A 5-fluorouracil-m-formylbenzene-sulfonate.

USE: Decomposable into each component in vivo, and with both the physiological actions of 5-fluorouracil and benzaldehyde or its derivative, particularly a carcinostatic. Administrable orally and easily preparable.

PROCESS: 5-Fluorouracil is dissolved in a slightly polar solvent, e.g. benzene, toluene, cyclohexane, or dichloroethane, and reacted with sulfonic, carboxylic or sulfinic acid derivative of formylbenzene to give the objective compound of formula I.

Data supplied from the esp@cenet database - Patent Abstracts of Japan

⑯ 日本国特許庁 (JP) ⑯ 特許出願公開
 ⑰ 公開特許公報 (A) 昭55-59173

⑮ Int. Cl.³
 C 07 D 239/54
 // A 61 K 31/505

識別記号 庁内整理番号
 6670-4C

⑯ 公開 昭和55年(1980)5月2日
 発明の数 1
 審査請求 未請求

(全2頁)

⑯ 新規な5-フルオロウラシル誘導体

⑰ 特 願 昭53-131480
 ⑰ 出 願 昭53(1978)10月27日
 ⑰ 発明者 板橋国夫

国立市東2の27の8

⑰ 出願人 科研化学株式会社
 東京都文京区本駒込2の28の8
 ⑰ 代理人 弁理士 小林正雄

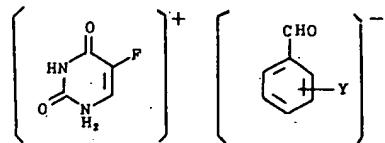
明細書

発明の名称

新規な5-フルオロウラシル誘導体

特許請求の範囲

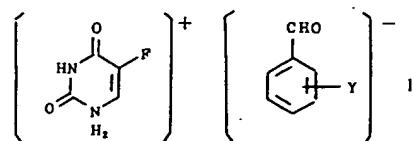
一般式



(式中Yは基SO₃、CO₃又はSO₄を示す)で表わされる5-フルオロウラシル誘導体。

発明の詳細な説明

本発明は、治療上有用な一般式



(式中Yは基SO₃、CO₃又はSO₄を示す)で表わされる5-フルオロウラシルの新規な塩に関する。

式1の化合物は、次のようにして製造することができる。ベンズアルデヒドのフェニル核に直接又はメチレン基を介してブレンステッド酸型の酸性基を結合させた化合物、例えばホルミルベンゼンスルホン酸、カルボン酸又はースルフィン酸は、極性の小さい溶媒、例えばベンゼン、トルエン、シクロヘキサン、ジクロルエタンなどに溶解した5-フルオロウラシルと反応し、式1のイソ尿素型の塩を形成して沈殿する。この反応は通常は室温に放置するだけで進行し、ほぼ定量的収率で目的物質を生成する。

式1の新規化合物は生体内で各成分に分解し、5-フルオロウラシル及びベンズアルデヒドもしくはベンズアルデヒド誘導体の両方の生理作用を示し、特に制癌剤として有用である。ウラシル誘導体の制癌作用は公知である。ベンズアルデヒドも優れた制癌作用を示しかつ毒性がき

わめて低く、しかも速かに生体外に排泄される
ので副作用を生じない物質である（特開昭52
-108027号公報参照）。

本発明の化合物は経口投与することができ、
しかも粉末状であるため他の薬剤、補助剤など
と混合し、種々の剤形の製剤に容易に加工でき
る利点を有する。

実施例

トルエン100mlにローホルミルベンゼンス
ルホン酸1.86g（0.01モル）を溶解し、5
一フルオロウラシル1.3g（0.01モル）のト
ルエン溶液に加えて室温に放置する。析出した
結晶を5時間真空乾燥すると、融点135～1
45℃の5一フルオロウラシルローホルミル
ベンゼンスルホン酸塩が得られる。收率は定量
的である。

出願人 科研化学株式会社
代理人 弁理士 小林正雄